- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: A01N 43/90 // (A01N 43/90, 43:84)
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/007075
- (22) Internationales Anmeldedatum:

30. Juni 2004 (30.06.2004)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

103 31 452.0

10. Juli 2003 (10.07.2003) DE 16. Juli 2003 (16.07.2003) DE

- 103 32 432.1 16. Juli 2003 (16.07.2003) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; 67056 Ludwigshafen (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TORMO I BLASCO, Jordi [ES/DE]; Carl-Benz-Str. 10-3, 69514 Laudenbach (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Höhnhausen 18, 67157 Wachenheim (DE). SCHERER, Maria [DE/DE]; Hermann-Jürgens-Strasse 30, 76829 Godramstein (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Jahnstr. 8, 67251 Freinsheim (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]; Donnersbergstrasse 9, 67117 Limburgerhof (DE). SCHÖFL, Ulrich [DE/DE]; Erlenstr. 8, 68782 Brühl (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGE-SELLSCHAFT; 67056 Ludwigshafen (DE).

- (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

- (54) Title: FUNGICIDAL MIXTURES FOR CONTROLLING RICE PATHOGENS
- (54) Bezeichnung: FUNGIZIDE MISCHUNGEN ZUR BEKÄMPFUNG VON REISPATHOGENEN

- (57) Abstract: Disclosed are fungicidal mixtures for controlling rice pathogens, containing 1) a triazolopyrimidine derivative of formula (I) and 2) fenpropimorph of formula (II) at a synergistically effective quantity as active components. Also disclosed are methods for controlling rice pathogens by means of mixtures of compound I and compound II, the use of compound I along with compound II for producing such mixtures, and agents containing said mixtures.
- (57) Zusammenfassung: Fungizide Mischungen zur Bekämpfung von Reispathogenen, enthaltend als aktive Komponenten das Triazolopyrimidinderivat der Formel (I) und 2) Fenpropimorph der Formel (II),in einer synergistisch wirksamen Menge, Verfahren zur Bekämpfung von Reispathogenen mit Mischungen der Verbindung I mit der Verbindung II und die Verwendung der Verbindung I mit der Verbindung II zur Herstellung derartiger Mischungen sowie Mittel, die diese Mischungen enthalten.

Fungizide Mischungen zur Bekämpfung von Reispathogenen

Beschreibung

- 5 Die vorliegende Erfindung betrifft fungizide Mischungen zur Bekämpfung von Reispathogenen, enthaltend als aktive Komponenten
 - 1) das Triazolopyrimidinderivat der Formel I,

10 und

2) Fenpropimorph der Formel II,

in einer synergistisch wirksamen Menge.

15

Außerdem betrifft die Erfindung ein Verfahren zur Bekämpfung von Reispathogenen mit Mischungen der Verbindung I mit der Verbindung II und die Verwendung der Verbindung I mit der Verbindung II zur Herstellung derartiger Mischungen sowie Mittel, die diese Mischungen enthalten.

20

Die Verbindung I, 5-Chlor-7-(4-methyl-piperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluor-phenyl)-[1,2,4]tri-azolo[1,5-a]pyrimidin, ihre Herstellung und deren Wirkung gegen Schadpilze ist aus der Literatur bekannt (WO 98/46607).

- Die Verbindung II, 4-[3-(4-tert-Butyl-phenyl)-2-methyl-propyl]-2,6-dimethyl-morpholin, ihre Herstellung und deren Wirkung gegen Schadpilze ist ebenfalls aus der Literatur bekannt (DE 26 56 747, DE 27 52 096; common name: Fenpropimorph). Fenpropimorph ist seit Langem im Markt etabliert, hauptsächlich als Getreidefungizid gegen Mehltau- und Rostkrankheiten, die durch Ascomyceten, bzw. Basidiomyceten verur-
- 30 sacht werden.

WO 2005/004608

Mischungen von Triazolopyrimidinderivaten mit Fenpropimorph sind allgemein aus EP-A 988 790 bekannt. Die Verbindung I ist von der allgemeinen Offenbarung dieser Schrift umfasst, ist jedoch nicht explizit erwähnt. Die Kombination der Verbindung I mit Fenpropimorph ist daher neu.

2

PCT/EP2004/007075

5

Die aus EP-A 988 790 bekannten synergistischen Mischungen werden als fungizid wirksam gegen verschiedene Krankheiten von Getreide, Obst und Gemüse, wie z. B. Mehltau an Weizen und Gerste oder Grauschimmel an Äpfeln beschrieben.

Aufgrund der speziellen Kultivierungsbedingungen von Reispflanzen bestehen deutlich andere Anforderungen an ein Reisfungizid als an Fungizide, die im Getreide- oder Obstbau angewandt werden. Unterschiede bestehen in der Anwendungsmethode: Neben der vielerorts angewandten Blattapplikation wird im modernen Reisanbau das Fungizid direkt bei, oder kurz nach der Aussaat auf den Boden ausgebracht. Das Fungizid wird über die Wurzeln in die Pflanze aufgenommen und im Pflanzensaft in der Pflanze zu den zu schützenden Pflanzenteilen transportiert wird. Eine hohe Systemik ist daher für Reisfungizide essentiell. Im Getreide- oder Obstbau hingegen wird das Fungizid üblicherweise auf die Blätter oder die Früchte appliziert, daher spielt in diesen Kulturen die Systemik der Wirkstoffe eine erheblich geringere Rolle.

20

Auch sind in Reis andere Pathogene typisch als in Getreide oder Obst. *Pyricularia* oryzae und Corticium sasakii (syn. Rhizoctonia solani) sind die Erreger der bedeutendsten Krankheiten von Reispflanzen. Rhizoctonia solani ist das einzige landwirtschaftlich bedeutende Pathogen innerhalb der Unterklasse Agaricomycetidae. Dieser Pilz befällt die Pflanze nicht wie die meisten anderen Pilze über Sporen, sondern über eine Mycelinfektion.

Aus diesem Grund sind Erkenntnisse zur fungiziden Wirkung von Getreide- oder Obstbau nicht auf Reiskulturen übertragbar.

30

35

25

Praktische Erfahrungen in der Landwirtschaft haben gezeigt, dass der wiederholte und ausschließliche Einsatz eines Einzelwirkstoffs bei der Bekämpfung von Schadpilzen in vielen Fällen zur schnellen Selektion von solchen Pilzstämmen führen kann, die gegen den betreffenden Wirkstoff eine natürliche oder adaptierte Resistenz entwickelt haben. Eine wirksame Bekämpfung dieser Pilze mit dem betreffenden Wirkstoff ist dann nicht mehr möglich.

Um die Gefahr der Selektion von resistenten Pilzstämmen zu verringern, werden heutzutage zur Bekämpfung von Schadpilzen üblicherweise Mischungen verschiedener

Wirkstoffe eingesetzt. Durch Kombination von Wirkstoffen mit unterschiedlichen Wirkungsmechanismen kann der Bekämpfungserfolg über längere Zeit gesichert werden.

Im Hinblick auf effektives Resistenzmanagement und eine wirkungsvolle Bekämpfung von Reispathogenen bei möglichst geringen Aufwandmengen lagen der vorliegenden 5 Erfindungen Mischungen als Aufgabe zugrunde, die bei verringerter Gesamtmenge an ausgebrachten Wirkstoffen eine verbesserte Wirkung gegen die Schadpilze zeigen.

Demgemäss wurden die eingangs definierten Mischungen gefunden. Es wurde außerdem gefunden, dass sich bei gleichzeitiger gemeinsamer oder getrennter Anwendung 10 der Verbindungen I und der Verbindung II oder bei Anwendung der Verbindungen I und der Verbindung II nacheinander Reispathogene besser bekämpfen lassen als mit den Einzelverbindungen.

- Bevorzugt setzt man bei der Bereitstellung der Mischungen die reinen Wirkstoffe I und 15 II ein, denen man je nach Bedarf weitere Wirkstoffe III und IV gegen Schadpilze oder andere Schädlinge wie Insekten, Spinntiere oder Nematoden, oder auch herbizide oder wachstumsregulierende Wirkstoffe oder Düngemittel beimischen kann.
- Als weitere Wirkstoffe im voranstehenden Sinne kommen insbesondere Fungizide 20 ausgewählt aus der folgenden Gruppe in Frage:
 - Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,

30

35

40

- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph, 25
 - Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
 - Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hexaconazol, Imazalil, Ipconazol, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Simeconazol, Tebuconazol, Tetraconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
 - Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
 - Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb. Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
 - Heterocylische Verbindungen wie Anilazin, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Famoxadon, Fenamidon, Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Picobenzamid, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxyfen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,

WO 2005/004608 PCT/EP2004/007075

4

- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl,
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
- 5 Schwefel,

10

- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Phosphorige Säure, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid,
- Strobilurine wie Fluoxastrobin, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolylfluanid,
- 15 Zimtsäureamide und Analoge wie Flumetover.

In einer Ausführungsform der erfindungsgemäßen Mischungen werden den Verbindungen I und II ein weiteres Fungizid III oder zwei Fungizide III und IV beigemischt.

20 Als Komponenten III und IV kommen insbesondere die folgenden Fungizide in Frage:

Aminderivate wie Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph;

Azole wie Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafol, Hexaconazol, Ipconazol, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Simeconazol, Tebuconazol, Tetraconazol, Triflumizol, Triticonazol; Heterocylische Verbindungen wie Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Cyazofamid, Fenarimol, Flutolanil, Picobenzamid, Proquinazid, Pyrifenox, Quinoxyfen, Thiophanat-

30 methyl;

Dithiocarbamate wie Maneb, Mancozeb, Metiram, Thiram; und Strobilurine wie Fluoxastrobin, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,

Sonstige Fungizide wie Benthiavalicarb, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Diclofluanid,
Fenhexamid, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Phosphorige Säure, Iprovalicarb,
Metrafenon und Pencycuron.

Mischungen der Verbindungen I und II mit einer Komponente III sind bevorzugt. Besonders bevorzugt sind Mischungen der Verbindungen I und II.

WO 2005/004608 PCT/EP2004/007075

5

Die Mischungen der Verbindungen I und II bzw. die gleichzeitige gemeinsame oder getrennte Verwendung der Verbindungen I und der Verbindung II zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen Reispathogene aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten und Basidiomyceten. Sie können zur Saatgutbehandlung, wie auch als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden. bevorzugt erfolgt die Applikation der Verbindungen I und II durch Besprühen der Blätter.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung von Schadpilzen an Reispflanzen und an deren Saatgut, wie *Bipolaris-* und *Drechslera-*Arten, sowie *Pyricularia oryzae*. Insbesondere eignen sie sich zur Bekämpfung der Blattscheidenkrankheit an Reis, die durch *Corticium sasakii* (syn. *Rhizoctonia solani*) verursacht wird.

Darüber hinaus ist die erfindungsgemäße Kombination der Verbindungen I und II auch zur Bekämpfung anderer Pathogene geeignet, wie z. B. Septoria- und Puccinia-Arten in Getreide wie Weizen oder Gerste und Alternaria- und Botrytis-Arten in Gemüse, Obst und Wein.

Die Verbindung I und die Verbindung II können gleichzeitig gemeinsam oder getrennt oder nacheinander aufgebracht werden, wobei die Reihenfolge bei getrennter Applikation im allgemeinen keine Auswirkung auf den Bekämpfungserfolg hat.

Die Verbindung I und die Verbindung II werden üblicherweise in einem Gewichtsverhältnis von 100:1 bis 1:100, vorzugsweise 20:1 bis 1:50, insbesondere 10:1 bis 1:10 angewandt.

25

5

10

15

20

Die Komponenten III und IV werden ggf. im Verhältnis von 20:1 bis 1:20 zu der Verbindung I zugemischt.

Die Aufwandmengen der erfindungsgemäßen Mischungen liegen je nach Art der Ver-30 bindung und des gewünschten Effekts bei 5 g/ha bis 2000 g/ha, vorzugsweise 50 bis 1500 g/ha, insbesondere 50 bis 750 g/ha.

Die Aufwandmengen für die Verbindung I liegen entsprechend in der Regel bei 1 bis 1000 g/ha, vorzugsweise 10 bis 750 g/ha, insbesondere 20 bis 500 g/ha.

35

Die Aufwandmengen für die Verbindung II liegen entsprechend in der Regel bei 1 bis 1000 g/ha, vorzugsweise 10 bis 750 g/ha, insbesondere 20 bis 500 g/ha.

PCT/EP2004/007075

15

20

25

30

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Aufwandmengen an Mischung von . 0,001 bis 1 g/kg Saatgut, vorzugsweise 0,01 bis 0,5 g/kg, insbesondere 0,01 bis 0,1 g/kg verwendet.

Bei der Bekämpfung für Reispflanzen pathogener Schadpilze erfolgt die getrennte oder gemeinsame Applikation der Verbindungen I und II oder der Mischungen aus den Verbindungen I und II durch Besprühen oder Bestäuben der Samen, der Sämlinge, der Pflanzen oder der Böden vor oder nach der Aussaat der Pflanzen oder vor oder nach dem Auflaufen der Pflanzen. Bevorzugt erfolgt die Applikation der Verbindungen gemeinsam oder getrennt durch Granulatapplikation oder Bestäuben der Böden.

Die erfindungsgemäßen Mischungen, bzw. die Verbindungen I und II können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butryolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,
- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphtalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkyl-

arylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubmittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nussschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

- Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% der Wirkstoffe. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.
- 30 Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

35

- A) Wasserlösliche Konzentrate (SL)

 10 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.
- B) Dispergierbare Konzentrate (DC)
 20 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

WO 2005/004608 PCT/EP2004/007075

8

C) Emulgierbare Konzentrate (EC)

15 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

D) Emulsionen (EW, EO)

40 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

E) Suspensionen (SC, OD)

- 20 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.
- F) Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG) 50 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

25

5

10

G) Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)
75 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in
Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

30

40

- Produkte f
 ür die Direktapplikation
- H) Stäube (DP)

5 Gew. Teile der Wirkstoffe werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubmittel.

I) Granulate (GR, FG, GG, MG)

0.5 Gew-Teile der Wirkstoffe werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

9

ULV- Lösungen (UL) J)

10 Gew.-Teile der Wirkstoffe werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

5

10

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubmitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet wer-15 den. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermitttel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Ver-20 dünnung mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

30

40

25

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

35

Die Verbindungen I und II, bzw. die Mischungen oder die entsprechenden Formulierungen werden angewendet, indem man die Schadpilze, die von ihnen freizuhaltenden Pflanzen, Samen, Böden, Flächen, Materialien oder Räume mit einer fungizid wirksamen Menge der Mischung, bzw. der Verbindungen I und II bei getrennter Ausbringung, behandelt. Die Anwendung kann vor oder nach dem Befall durch die Schadpilze erfolgen.

Die fungizide Wirkung der Verbindung und der Mischungen lässt sich durch folgende Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als eine Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Anwendungsbeispiel - Wirksamkeit gegen die Blattscheidenkrankheit an Reis verursacht durch Corticium sasakii (syn. Rhizoctonia solani)

15

20

10

Töpfe mit Reispflanzen der Sorte "Tai-Nong 67" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden auf die Töpfe mit *Corticium sasakii* infizierte Haferkörner ausgelegt (jeweils 5 Körner pro Topf). Anschließend wurden die Pflanzen in einer Kammer bei 26°C und maximaler Luftfeuchte aufgestellt. Nach 11 Tagen hatte sich die Blattscheidenkrankheit auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

Die Auswertung erfolgt durch Feststellung der befallenen Pflanzen in Prozent. Diese Prozent-Werte wurden in Wirkungsgrade umgerechnet.

Der Wirkungsgrad (W) wird nach der Formel von Abbot wie folgt berechnet:

$$W = (1 - \alpha/\beta) \cdot 100$$

30

35

40

- a entspricht dem Pilzbefall der behandelten Pflanzen in % und
- β entspricht dem Pilzbefall der unbehandelten (Kontroll-) Pflanzen in %

Bei einem Wirkungsgrad von 0 entspricht der Befall der behandelten Pflanzen demjenigen der unbehandelten Kontrollpflanzen; bei einem Wirkungsgrad von 100 weisen die behandelten Pflanzen keinen Befall auf.

Die zu erwartenden Wirkungsgrade der Wirkstoffmischungen werden nach der Colby Formel [R.S. Colby, Weeds 15, 20-22 (1967)] ermittelt und mit den beobachteten Wirkungsgraden verglichen.

Colby Formel:

$$E = x + y - x \cdot y/100$$

- zu erwartender Wirkungsgrad, ausgedrückt in % der unbehandelten Kontrolle, 5 Ε beim Einsatz der Mischung aus den Wirkstoffen A und B in den Konzentrationen a und b
 - der Wirkungsgrad, ausgedrückt in % der unbehandelten Kontrolle, beim Einsatz X des Wirkstoffs A in der Konzentration a
- der Wirkungsgrad, ausgedrückt in % der unbehandelten Kontrolle, beim Einsatz 10 У des Wirkstoffs B in der Konzentration b

Als Vergleichswirkstoffe wurden die von den in EP-A 988 790 beschriebenen Fenpropimorph-Mischungen bekannten Verbindungen A und B verwendet:

15 -

Tabelle A - Einzelwirkstoffe

Tabelle A	Einzelwirkstoffe		
	115.4465	Wirkstoffkonzentration	Wirkungsgrad in % der
Beispiel	Wirkstoff	in der Spritzbrühe [ppm]	unbehandelten Kontrolle
1	Kontrolle (unbehandelt)	-	(90% Befall)
		4	67
2	l	1	33
		4	0
3	II (Fenpropimorph)	1	0
4.00		4	0
4	Vergleich A	1	. 0
	Variable D	4	72
5	Vergleich B	1	0

Tabelle B – erfindungsgemäße Mischungen

Beispiel	Wirkstoffmischung Konzentration Mischungsverhältnis	beobachteter Wirkungsgrad	berechneter Wirkungsgrad*)
6	i + ii 1 + 4 ppm 1:4	100	33
7	l + II 4 + 1 ppm 4:1	100	67

^{*)} berechneter Wirkungsgrad nach der Colby-Formel

5 Tabelle C - Vergleichsversuche - Mischungen bekannt aus EP-A 988 780

Beispiel	Wirkstoffmischung Konzentration Mischungsverhältnis	beobachteter Wirkungsgrad	· berechneter Wirkungsgrad*)
8	A + II 1 + 4 ppm 1:4	0	o
9	A + II 4 + 1 ppm 4:1	0	0
10	B + II 1 + 4 ppm 1:4	0	0
11	B + II 4 + 1 ppm 4:1	67	72

^{*)} berechneter Wirkungsgrad nach der Colby-Formel

Aus den Ergebnissen der Versuche geht hervor, dass die erfindungsgemäßen Mischungen aufgrund des starken Synergismus gegen die Blattscheidenkrankheit erheblich besser wirksam sind, als die aus EP-A 988 780 bekannten Fenpropimorph-Mischungen, obwohl die Vergleichsverbindung B als Einzelwirkstoff mit der Verbindung I vergleichbar wirksam ist.

Patentansprüche

- 1. Fungizide Mischungen, enthaltend
- 5 1) das Triazolopyrimidinderivat der Formel I,

und

2) Fenpropimorph der Formel II,

10

in einer synergistisch wirksamen Menge.

2. Fungizide Mischungen, enthaltend die Verbindung der Formel I und die Verbindung der Formel II in einem Gewichtsverhältnis von 100:1 bis 1:100.

15

- 3. Fungizides Mittel, enthaltend einen flüssigen oder festen Trägerstoff und eine Mischung gemäß Anspruch 1 oder 2.
- Verfahren zur Bekämpfung von reispathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, deren Lebensraum oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge der Verbindung I und der Verbindung II gemäß Anspruch 1 oder des Mittels gemäß Anspruch 3 behandelt.
- 25 5. Verfahren nach Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, dass man die Verbindungen I und II gemäß Anspruch 1 gleichzeitig, und zwar gemeinsam oder getrennt, oder nacheinander ausbringt.
- 6. Verfahren nach Anspruch 4, dadurch gekennzeichnet, dass man die Mischung gemäß Ansprüchen 1 oder 2 oder das Mittel gemäß Anspruch 3 in einer Menge von 5 g/ha bis 2000 g/ha aufwendet.

- 7. Verfahren nach Ansprüchen 4 und 5, dadurch gekennzeichnet, dass man die Mischung gemäß Ansprüchen 1 oder 2 oder das Mittel gemäß Anspruch 3 in einer Menge von 0,001 bis 1 g/kg Saatgut anwendet.
- 5 8. Verfahren nach Ansprüchen 4 bis 7, dadurch gekennzeichnet, dass der Schadpilze Corticium sasakii bekämpft wird.

10

9. Saatgut, enthaltend die Mischung gemäß Ansprüchen 1 oder 2 in einer Menge von 0,001 bis 1 g/kg.

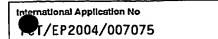
10. Verwendung der Verbindung I und der Verbindung II gemäß Anspruch 1 zur Herstellung eines zur Bekämpfung von Schadpilzen geeigneten Mittels.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

A. CLASSIF	CATION OF SUBJECT MATTER A01N43/90		
IPC /	//(A01N43/90,43:84)		
According to	International Patent Classification (IPC) or to both national classification	lon and IPC	
B. FIELDS		a cumbale)	
Minimum do	currentation searched (classification system followed by classification $A01N$	Tayrimosy	
•. • •			
Dogumentati	on searched other than minimum documentation to the extent that su	ch documents are included in the fields sea	arched
Documenta			
	ala base consulted during the International search (name of data base	and where gractical search terms used)	
EPO-1n1	ternal, CHEM ABS Data, WPI Data		
	•		į
C. DOCUME	ENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT	T	
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the rele	vant passages	Relevant to claim No.
Α	EP 0 988 790 A (AMERICAN CYANAMID	co)	
	29 March 2000 (2000-03-29) cited in the application		
	paragraph '0010!; table 1		
		THOMAS	
P,A	WO 2004/045288 A (BASF AG ; GROTE (DE); SCHOEFL ULRICH (DE); STIERL	RETNHARD	!
	(DE)) 3 June 2004 (2004-06-03)	11211111111	
	the whole document	·	
			•
		•	
			•
Furt	her documents are listed in the continuation of box C.	Patent family members are listed I	n annex.
Special ca	degories of cited documents:	"T" later document published after the inte or priority date and not in conflict with	mational filing date
"A" docume	ent defining the general state of the art which is not lered to be of particular relevance	cited to understand the principle or the invention	eory underlying the
	document but published on or after the international	">(" document of particular relevance; the cannot be considered novel or cannot	taimed invention
'L' docume	ent which may throw doubts on priority claim(s) or	involve an inventive step when the do	cument is taken alone
citatio	n or other special reason (as specified)	"Y" document of particular relevance; the cannot be considered to involve an indocument is combined with one or mo	ventive step when the
	ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or means	ments, such combination being obvious	us to a person skilled
	ent published prior to the international filling date but han the priority date claimed	in the art. *&* document member of the same patent	family
Date of the	actual completion of the international search	Date of mailing of the international sea	rch report
6	September 2004	15/09/2004	
		Authorized officer	
I IVAITHE BING	mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentiaan 2	ANTIONED ONDE	
	NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo ni,	Bertrand, F	
l	Fax: (+31-70) 340-3016		

INTERNATIONAL SEARCH REPORT



Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)	Publication date
EP 0988790	A	29-03-2000	AT DE DE DK EP ES PT SI	240648 T 69908052 D 69908052 T 988790 T 0988790 A 2203021 T 988790 T 988790 T	2 27-11-2003 3 22-09-2003 1 29-03-2000 3 01-04-2004 31-10-2003
WO 2004045288	Α	03-06-2004	MO	2004045288 A	2 03-06-2004

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen	•
T/EP2004/007075	

A. KLASSIF	A01N43/90		
IPK /	A01N43/90 //(A01N43/90,43:84)		
	ernationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klass	ifikation und der IPK	
	ICHIERTE GEBIETE er Mindestprütstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole	9)	
IPK 7	AOIN		
Recherchler	e aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, sow	reit diese unter die recherchierten Gebiete	fallen
Während de	r internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Na	me der Datenbank und evtl. verwendete S	Suchbegriffe)
EPO-Int	ternal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. ALS WE	SENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie®	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe	der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
	TO THE A CAMERIANA CHANANA	(0)	
Α	EP 0 988 790 A (AMERICAN CYANAMID 29. März 2000 (2000-03-29)	CO)	
	in der Anmeldung erwähnt		
	Absatz '0010!; Tabelle 1		
P,A	WO 2004/045288 A (BASF AG ; GROTE	THOMAS	
' , '	(DE): SCHOEFL ULRICH (DE); STIERL	REINHARD	
	(DE)) 3. Juni 2004 (2004-06-03)		
	das ganze Dokument		
ł			
1			
1			
1			
	·		
Well	tere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu sehmen	X Siehe Anhang Patentfamilie	
		T' Spätere Veröffentlichung, die nach den oder dem Prioritätsdatum veröffentlich	n internationalen Anmeldedatum
'A' Veröffe aber n	ntlichung, die den aligemeinen Stand der Technik definiert, sicht als besonders bedeutsam anzusehen ist	Anmeldung nicht kollidiert, sondern nu Erfindung zugrundeliegenden Prinzips	ır zum Verständnis des der
'E' älteres Anme	Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Idedatum veröffentlicht worden ist	Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer Bede	
'L' Verôffe	ntlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft er-	kann allein aufgrund dieser Veröffentil erfinderischer Tätigkeit beruhend betra	chung nicht als neu oder auf achtet werden
anden soll od	en im Recherchenbericht genannten Verontentuchung beiegt werden der die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie	kann nicht als auf erfinderischer Tätig	keit beruhend betrachtet
O' Veroffe	entlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung,	werden, wenn die Veröffentlichung mit Veröffentlichungen dieser Kategorie in	verbindung gebracht wird und
P Veröffe	Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht ntlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach Jeanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist	diese Verbindung für einen Fachmann & Veröffentlichung, die Mitglied derselber	
	Abschlusses der Internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Re	echerchenberichts
. 6	. September 2004	15/09/2004	_
Name und	Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde	Bevollmächligter Bediensteter	
	Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL – 2280 HV Rijswijk		
	Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo ni, Fax: (+31-70) 340-3016	Bertrand, F	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen T/EP2004/007075	
T/EP2004/007075	

im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
EP 0988790	Α	29-03-2000	AT DE	240648 69908052	T D1	15-06-2003 26-06-2003
			DE	69908052	-	27-11-2003
			DK	988790	T3	22-09-2003
			EP	0988790	A1	29-03-2000
			ES	2203021	T3	01-04-2004
			PT	988790	T	31-10-2003
			SI	988790	T1	31-10-2003
WO 2004045288	A	03-06-2004	WO	2004045288	A2	03-06-2004